



Europäisches Patentamt
European Patent Office
Office européen des brevets

(11) Numéro de publication:

**0 068 566
A1**

(12)

DEMANDE DE BREVET EUROPEEN

(21) Numéro de dépôt: 82200750.6

(51) Int. Cl.³: **A 61 K 9/20, A 21 D 2/08**

(22) Date de dépôt: 17.06.82

(30) Priorité: 30.06.81 BE 205270

(71) Demandeur: Société d'Importation de Parfumerie et de Produits Pharmaceutiques en abrégé "Sipar-Pharma" Société Anonyme, rue de l'Orme, 42, B-1040 Bruxelles (BE)

(43) Date de publication de la demande: 05.01.83
Bulletin 83/1

(72) Inventeur: Rousseau, Jean Augustin Louis, Rue Nicaise 6, B-1341 Ceroux-Mousty (BE)

(84) Etats contractants désignés: AT BE CH DE FR GB IT LI
LU NL SE

(74) Mandataire: De Brabanter, Maurice et al, Bureau VANDER HAEGHEN 63 Avenue de la Tolson d'Or, B-1060 Bruxelles (BE)

(54) Forme médicamenteuse d'une composition de matières comestible contenant un diméthylpolysiloxane fluide.

(57) L'invention concerne une forme médicamenteuse d'une composition de matières comestible contenant du diméthylpolysiloxane et éventuellement de la silice finement divisée dans un excipient cuit à base de farine de céréale et de sucre, de préférence sous forme de biscuit contenant environ 10% en poids de siméthicone.

EP 0 068 566 A1

ACTORUM AG

Forme médicamenteuse d'une composition de matières
comestible contenant un diméthylpolysiloxane fluide.

La présente invention est relative à une
forme médicamenteuse d'une composition de matières
comestible contenant comme ingrédient actif, un diméthyl-
polysiloxane fluide et éventuellement de la silice
finement divisée.

On connaît par le brevet britannique
No.2.033.915 des compositions de matières comestibles,
notamment sous forme de comprimés, de capsules, de gels
ou de suspensions, contenant un mélange de diméthylpoly-
siloxane fluide et de silice finement divisée, encore
dénommé diméthixone activée ou siméthicone, ayant des
propriétés lubrifiantes et anti-moussantes, destinées à
prévenir et à atténuer les conséquences des perturbations
du processus d'assimilation alimentaire qui entraînent une
distension gazeuse, un ballonnement et/ou des lourdeurs du
système digestif. Elles favorisent l'élimination des gaz
et protègent les muqueuses ou parois digestives, en
particulier celles de l'oesophage, de l'estomac et des
intestins en les couvrant d'une fine couche de substance
active de la composition susdite.

Les compositions de matières connues
présentent cependant divers inconvénients, notamment
un caractère organoleptique désagréable et un goût
insipide, qui n'incite pas à leur consommation et ne
favorise pas la salivation.

Leur aspect médicamenteux peut être un
obstacle psychologique à leur prise régulière, notamment
dans des lieux publics tels que des restaurants.

La quantité de sucre à incorporer dans les comprimés en vue d'obtenir l'édulcoration des ingrédients actifs peut être une source de contre-indications.

5

Lorsque les compositions de matières connues se présentent sous forme de comprimés à avaler, leurs ingrédients actifs ne sont libérés qu'au niveau de l'estomac ou de l'intestin, en sorte qu'ils n'agissent qu'avec retard et n'exercent que peu ou pas d'effets sur les voies digestives supérieures.

10

Lorsqu'elles se présentent sous forme de suspension ou de sirop, l'utilisateur éprouve des difficultés pour absorber une dose précise et le traitement ambulatoire est rendu plus difficile.

15

En outre, le sirop est sujet à une fermentation s'il n'est pas suffisamment aseptisé ni suffisamment surconcentré en sucre.

20

Les compositions liquides sont avalées sans mastication de telle sorte que l'absorption de ces produits ne favorise pas la sécrétion de salive à laquelle les ingrédients actifs doivent avantageusement se mélanger.

25

La présente invention vise à remédier aux inconvénients décrits ci-dessus et a pour objet un produit comestible du type décrit plus haut qui est facile et agréable à absorber à des doses prédéterminées, sans obstacles d'ordre psychologique ou autre.

30

L'invention concerne une forme médicamenteuse d'une composition de matières solide comestible contenant, comme ingrédient actif, un diméthylpolysiloxane fluide et éventuellement de la silice finement divisée, cette composition étant essentiellement caractérisée en ce qu'elle consiste en un biscuit.

La forme de présentation suivant l'invention, consiste avantageusement en un petit biscuit de forme quelconque, par exemple circulaire, bombée contenant environ 10% en poids de diméthylpolysiloxane activé
5 par 4 à 7% en poids de silice finement divisée.

Dans une forme de présentation particulière de l'invention, l'édulcoration desdites matières est obtenue par incorporation en quantités judicieusement choisies dans un biscuit contenant environ 64% de farine
10 de céréale, environ 12,5% de sucre et environ 10% de matières grasses.

L'exemple suivant décrit la composition d'un biscuit suivant l'invention à titre non limitatif.

15

EXEMPLE : Ingrédients (pour 100 g de biscuit).

a) Matières actives

20	Diméthicone activée (siméthicone)	10,6 g	Pharmacopée américaine XX, p. 724
----	--------------------------------------	--------	-----------------------------------

b) Excipients

	Farine (sans humidité)	64 g
25	Sucre	12,5 g
	Oleo Oil (boeuf fractionné)	9,4 g
	Eau	1,5 g
	Poudre de lait entier	1,5 g
	Sel	0,3 g
30	Bicarbonate de soude	0,1 g
	Ethylvanilline	0,01 g

c) Valeurs énergétiques

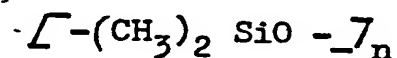
	Protides	6,8 g	
	Lipides	10,2 g	
5	Glucides	69,9 g	pour 100 g de produit fini
	KJoules	1668	
	Kcal	400	pour 100 g de produit fini

10 d) Valeur unitaire

	Poids net minimum par biscuit	1,4 g	
	Kcal par biscuit	environ 6	Kcal
15	Siméthicone par biscuit	: environ 0,148 g	

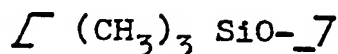
20 Les biscuits suivant la présente invention sont obtenus par un procédé classique de préparation de biscuits sensiblement secs impliquant la cuisson d'une pâte aqueuse à une température et pendant une durée suffisantes pour obtenir un produit sensiblement sec et croquant sans dégradation des ingrédients actifs.

25 La siméthicone utilisée dans les compositions de matières comestibles suivant l'invention est constituée d'un mélange de polymères de silicone linéaires complètement méthylés contenant des unités récurrentes de formule

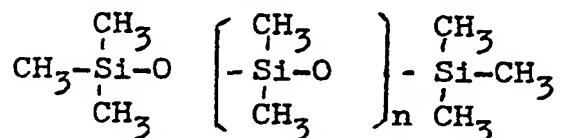


30 dans laquelle n est compris entre 200 et 350

stabilisée par des radicaux triméthylsiloxyle terminaux de formule



et de silice finement divisée. La siméthicone ne contient pas moins de 90,5% et pas plus de 99,0% de polydiméthylsiloxane de formule



où n est compris entre 200 et 350, tandis que sa teneur en silice est comprise entre 4.0 et 7.0% en poids.

Les compositions de matières sous forme de biscuit suivant l'invention sont, de préférence, absorbées à raison de deux biscuits d'un poids d'environ 1.4 g contenant environ 10% de siméthicone, avant chacun des principaux repas ou avant la prise d'une boisson ou d'un aliment susceptible de produire une irritation.

Pour obtenir les meilleurs résultats les produits doivent être mastiqués pendant quelques secondes avant d'être avalés. En cas de nécessité, on peut répéter la prise de deux biscuits après un repas indigeste ou au moment de l'apparition de symptômes de flatulence, distensions gazeuses, lourdeurs, ballonnements ou autres. Les biscuits sont également utilisables à titre préventif dans les cas où une protection des muqueuses du système digestif est souhaitée, pour éviter une irritation due aux alcools, épices, vinaigre, tabac et autres produits agressifs.

Aucun effet secondaire et aucune contre-indication ne sont à craindre étant donné

que la siméthicone n'est pas assimilée par l'organisme. Ce produit joue exclusivement un rôle physique et est éliminé tel quel. De plus, il n'affecte pas les fonctions enzymatiques digestives, la sécrétion d'acide ni l'assimilation des aliments et des médicaments. Les compositions suivant l'invention peuvent être absorbées par les adultes et les enfants, y compris les femmes enceintes, en raison de leur absence de toxicité, même régulièrement pendant une période prolongée.

La composition de matières suivant l'invention sous forme de petits biscuits est assimilable à des amuse-gueules que l'on absorbe communément avec un apéritif.

Elle se présente avantageusement sous forme de biscuits compacts et pauvres en valeurs caloriques permettant d'absorber facilement une dose assurant une efficacité appréciable, éventuellement emballés individuellement.

On a constaté que l'effet de soulagement des perturbations du système digestif est extrêmement rapide, sinon immédiat, lors de l'absorption d'une composition suivant l'invention sous forme de biscuits. Bien que la demanderesse ne désire pas être liée par une quelconque théorie, elle est d'avis que cette rapidité d'action est due à la salivation accrue qui se manifeste lors de la mastication des biscuits et assure la libération immédiate de la siméthicone et sa répartition uniforme dans la totalité du système digestif.

Il est évident que l'invention n'est pas limitée aux détails décrits plus haut et que de nombreuses modifications peuvent être apportées à ces détails sans sortir du cadre de l'invention.

Ainsi, la composition des biscuits décrite dans l'exemple donné plus haut peut varier, tant en ce qui concerne la nature que les proportions des composants de l'excipient.

La siméthicone peut être utilisée dans une proportion différente de celle indiquée dans l'exemple. Cette siméthicone peut être l'un ou l'autre des produits commerciaux à base de diméthylpolysiloxane.

- 5 L'emballage individuel précité peut être un emballage hermétique sous feuille d'aluminium ou un quelconque emballage étanche utilisé en particulier dans l'industrie des médicaments pour conserver un produit à l'abri de l'air et de l'humidité.

REVENDICATIONS

1. Forme médicamenteuse d'une composition de
matière solide comestible contenant comme ingrédient
5 actif, un diméthylpolysiloxane fluide et éventuellement
de la silice divisée, caractérisée en ce qu'elle consiste
en un biscuit.
2. Forme médicamenteuse suivant la revendica-
10 tion 1, caractérisée en ce que le biscuit contient environ
10% en poids de diméthylpolysiloxane activé par 4 à 7% en
poids de silice finement divisée.
3. Forme médicamenteuse suivant l'une quelconque
15 des revendications 1 et 2, caractérisée en ce que le biscuit
contient environ 64% de farine de céréale, environ 12,5% de
sucre et environ 10% de matières grasses.
4. Forme médicamenteuse suivant l'une quelconque
20 des revendications précédentes, caractérisée en ce que le
biscuit contient un arôme physiologiquement acceptable.
5. Forme médicamenteuse suivant l'une quelconque
des revendications précédentes, caractérisée en ce que le
25 biscuit sensiblement sec présente un poids d'environ 1.5
gramme.
6. Forme médicamenteuse suivant l'une quelconque
des revendications précédentes, caractérisée en ce que le
30 biscuit est emballé hermétiquement et individuellement sous
feuille d'aluminium.



Office européen
des brevets

RAPPORT DE RECHERCHE EUROPEENNE

0068566

EP 82 20 0750

DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS			
Catégorie	Citation du document avec indication, en cas de besoin, des parties pertinentes	Revendication concernée	CLASSEMENT DE LA DEMANDE (Int. Cl. 3)
Y	--- CHEMICAL ABSTRACTS, vol.95, no.4, 27 juillet 1981, page 342, résumé no.30432w, Columbus, Ohio (US) & RO - A - 65 343 (INTERPRINDEREA DE MORARIT, PANIFICATIE SI PRODUSE FAINOASE) (20 avril 1979) * abrégé *	1	A 61 K 9/20 A 21 D 2/08
D,Y	--- GB-A-2 033 915 (AMERICAN HOME PRODUCTS) * page 1, lignes 50-99; revendications 1-5,18,22 *	1,2	
Y	--- US-A-3 422 189 (RIDER) * colonne 1, ligne 49 - colonne 2, ligne 35; revendications *	1,2	
Y	--- US-A-4 127 650 (BUEHLER) * revendications *	1,2	DOMAINES TECHNIQUES RECHERCHES (Int. Cl. 3)
Y	--- DE-A-1 467 745 (C.F. ASCHE & CO.) * revendications *	1,2	A 61 K 9/00 A 21 D 2/00 A 23 G 1/00 A 23 G 3/00
A	--- EP-A-0 009 913 (BEECHAM) * revendications 1-6; page 1, lignes 1-32 *	1	
P,X	--- BE-A- 889 453 (SIPAR PHARMA) * en entier *	1-6	

Le present rapport de recherche a été établi pour toutes les revendications			
Lieu de la recherche LA HAYE		Date d'achèvement de la recherche 19-10-1982	Examineur WILLEKENS G.E.J.
CATEGORIE DES DOCUMENTS CITES			
X : particulièrement pertinent à lui seul Y : particulièrement pertinent en combinaison avec un autre document de la même catégorie A : arrière-plan technologique O : divulgation non-écrite P : document intercalaire		T : théorie ou principe à la base de l'invention E : document de brevet antérieur, mais publié à la date de dépôt ou après cette date D : cité dans la demande L : cité pour d'autres raisons & : membre de la même famille, document correspondant	